## (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



## 

(43) 国際公開日 2005年7月14日(14.07.2005)

**PCT** 

(10) 国際公開番号 WO 2005/063709 A1

(51) 国際特許分類7: 401/14, 403/14, 401/04, 405/14, 417/04, A61K 31/496, 31/506, A61P 35/02, 43/00

(21) 国際出願番号:

(22) 国際出願日:

2004年12月27日(27.12.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ: 特額 2003-431398

2003年12月25日(25.12.2003) ア

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本新 薬株式会社 (NIPPON SHINYAKU CO., LTD.) (JTVJP); 〒6018550 京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町 14番地 Kyoto (JP).

(72) 発明者; および

WO 2005/063709 A1

(75) 発明者/出額人(米国についてのみ): 浅木 哲夫(ASAKI, Tetsuo) [JP/JP]; 〒6110041 京都府宇治市核島町月夜 6-1 朝日ブラザ宇治721 Kyoto (JP). 杉山 幸輝 (SUGIYAMA, Yukiteru) [JP/JP]; 〒6078182 京都府京 都市山科区大宅板ノ辻町39番地日本新楽山科社宅 1-2 C Kyoto (JP). 瀬川 純 (SEGAWA, Jun) (JP/JP); 〒 6310806 奈良県奈良市朱雀 1 丁目 4-1 6 Nara (JP).

C07D 213/74, 239/42, (74) 代理人: 清水尚人,外(SHIMIZU; Naoto et al.); 〒 6018550京都府京都市南区吉祥院西ノ庄門口町14番 地 日本新菜株式会社 知的財産部 Kyoto (JP).

PCT/JP2004/019553 (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が 可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KB, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

> (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護 が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BP, BJ, CP, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類: 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: AMIDE DERIVATIVE AND MEDICINE

(54) 発明の名称: アミド誘導体及び医薬

(57) Abstract: An amide derivative or salt thereof which has excellent BCR-ABL tyrosin kinase inhibitory activity. The amide derivative is represented by the following general formula [1]: [1] [6] (wherein R<sup>1</sup> represents -CH<sub>2</sub>-R<sup>11</sup> (R<sup>11</sup> represents a nitrogenous saturated heterocyclic group), etc.; R2 represents alkyl, halogeno, haloalkyl, etc.; R3 represents hydrogen, etc.; Het1 represents the group represented by the chemical formula [6] shown above, etc.; and Het2 represents pyrimidinyl, etc.). Also provided is a medicinal composition containing the amide derivative or salt as an active ingredient. The compounds are useful as a BCR-ABL tyrosin kinase inhibitor.

/続葉有/

## (57) 要約:

本発明の目的は、優れたBCR-ABLチロシンキナーゼの阻害活性を有するアミド誘導体又はその塩を提供することにある。

本発明は、次の一般式[1]

(式中、R'は-CH:-R''(R''は含窒素飽和ヘテロ類基を表す。) 等を表し、R'はアルキル、ハロゲン、ハロアルキル等を表し、R'は、水素等を表し、Hetlは上記の化学式 [6] の基等を表し、Het2はピリミジニル等を表す。) で表されるアミド誘導体又はその塩、並びにそれらを有効成分とする医薬組成物で構成される。

本発明化合物は、BCR-ABLチロシンキナーゼ阻害剤として有用である。